

VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS

10/019902

PCT TECH CENTER 1600/2900

REC'D 03 JUN 2002

WIPO PCT

INTERNATIONALER VORLÄUFIGER PRÜFUNGSBERICHT

(Artikel 36 und Regel 70 PCT)



Aktenzeichen des Anmelders oder Anwalts EA-PCT-11177	WEITERES VORGEHEN siehe Mitteilung über die Übersendung des internationalen vorläufigen Prüfungsberichts (Formblatt PCT/IPEA/416)	
Internationales Aktenzeichen PCT/EP00/06139	Internationales Anmeldedatum (Tag/Monat/Jahr) 30/06/2000	Prioritätsdatum (Tag/Monat/Jahr) 30/06/1999
Internationale Patentklassifikation (IPK) oder nationale Klassifikation und IPK A61K47/48		
Anmelder SYNTESOME GESELLSCHAFT FÜR MEDIZINISCHE ...		

- Dieser internationale vorläufige Prüfungsbericht wurde von der mit der internationalen vorläufigen Prüfung beauftragten Behörde erstellt und wird dem Anmelder gemäß Artikel 36 übermittelt.
- Dieser BERICHT umfaßt insgesamt 7 Blätter einschließlich dieses Deckblatts.
 - ☐ Außerdem liegen dem Bericht ANLAGEN bei; dabei handelt es sich um Blätter mit Beschreibungen, Ansprüchen und/oder Zeichnungen, die geändert wurden und diesem Bericht zugrunde liegen, und/oder Blätter mit vor dieser Behörde vorgenommenen Berichtigungen (siehe Regel 70.16 und Abschnitt 607 der Verwaltungsrichtlinien zum PCT).

Diese Anlagen umfassen insgesamt 1 Blätter.

3. Dieser Bericht enthält Angaben zu folgenden Punkten:

- I ☒ Grundlage des Berichts
- II ☐ Priorität
- III ☒ Keine Erstellung eines Gutachtens über Neuheit, erfinderische Tätigkeit und gewerbliche Anwendbarkeit
- IV ☐ Mangelnde Einheitlichkeit der Erfindung
- V ☒ Begründete Feststellung nach Artikel 35(2) hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung
- VI ☐ Bestimmte angeführte Unterlagen
- VII ☐ Bestimmte Mängel der internationalen Anmeldung
- VIII ☐ Bestimmte Bemerkungen zur internationalen Anmeldung

Datum der Einreichung des Antrags 05/01/2001	Datum der Fertigstellung dieses Berichts 30.05.2002
Name und Postanschrift der mit der internationalen vorläufigen Prüfung beauftragten Behörde:  Europäisches Patentamt - P.B. 5818 Patentlaan 2 NL-2280 HV Rijswijk - Pays Bas Tel. +31 70 340 - 2040 Tx: 31 651 epo nl Fax: +31 70 340 - 3016	Bevollmächtigter Bediensteter Dullaart, A Tel. Nr. +31 70 340 3290 

I. Grundlage des Berichts

1. Hinsichtlich der **Bestandteile** der internationalen Anmeldung (*Ersatzblätter, die dem Anmeldeamt auf eine Aufforderung nach Artikel 14 hin vorgelegt wurden, gelten im Rahmen dieses Berichts als "ursprünglich eingereicht" und sind ihm nicht beigefügt, weil sie keine Änderungen enthalten (Regeln 70.16 und 70.17)*):
Beschreibung, Seiten:

1-49 ursprüngliche Fassung

Patentansprüche, Nr.:

1-24 ursprüngliche Fassung

Zeichnungen, Blätter:

1/3-3/3 ursprüngliche Fassung

2. Hinsichtlich der **Sprache**: Alle vorstehend genannten Bestandteile standen der Behörde in der Sprache, in der die internationale Anmeldung eingereicht worden ist, zur Verfügung oder wurden in dieser eingereicht, sofern unter diesem Punkt nichts anderes angegeben ist.

Die Bestandteile standen der Behörde in der Sprache: zur Verfügung bzw. wurden in dieser Sprache eingereicht; dabei handelt es sich um

- ☐ die Sprache der Übersetzung, die für die Zwecke der internationalen Recherche eingereicht worden ist (nach Regel 23.1(b)).
- ☐ die Veröffentlichungssprache der internationalen Anmeldung (nach Regel 48.3(b)).
- ☐ die Sprache der Übersetzung, die für die Zwecke der internationalen vorläufigen Prüfung eingereicht worden ist (nach Regel 55.2 und/oder 55.3).

3. Hinsichtlich der in der internationalen Anmeldung offenbarten **Nucleotid- und/oder Aminosäuresequenz** ist die internationale vorläufige Prüfung auf der Grundlage des Sequenzprotokolls durchgeführt worden, das:

- ☐ in der internationalen Anmeldung in schriftlicher Form enthalten ist.
- ☐ zusammen mit der internationalen Anmeldung in computerlesbarer Form eingereicht worden ist.
- ☐ bei der Behörde nachträglich in schriftlicher Form eingereicht worden ist.
- ☐ bei der Behörde nachträglich in computerlesbarer Form eingereicht worden ist.
- ☐ Die Erklärung, daß das nachträglich eingereichte schriftliche Sequenzprotokoll nicht über den Offenbarungsgehalt der internationalen Anmeldung im Anmeldezeitpunkt hinausgeht, wurde vorgelegt.
- ☐ Die Erklärung, daß die in computerlesbarer Form erfassten Informationen dem schriftlichen Sequenzprotokoll entsprechen, wurde vorgelegt.

4. Aufgrund der Änderungen sind folgende Unterlagen fortgefallen:

**INTERNATIONALER VORLÄUFIGER
PRÜFUNGSBERICHT**

Internationales Aktenzeichen PCT/EP00/06139

- ☐ Beschreibung, Seiten:
☐ Ansprüche, Nr.:
☐ Zeichnungen, Blatt:

5. ☐ Dieser Bericht ist ohne Berücksichtigung (von einigen) der Änderungen erstellt worden, da diese aus den angegebenen Gründen nach Auffassung der Behörde über den Offenbarungsgehalt in der ursprünglich eingereichten Fassung hinausgehen (Regel 70.2(c)).

(Auf Ersatzblätter, die solche Änderungen enthalten, ist unter Punkt 1 hinzuweisen; sie sind diesem Bericht beizufügen).

6. Etwaige zusätzliche Bemerkungen:

III. Keine Erstellung eines Gutachtens über Neuheit, erfinderische Tätigkeit und gewerbliche Anwendbarkeit

1. Folgende Teile der Anmeldung wurden nicht daraufhin geprüft, ob die beanspruchte Erfindung als neu, auf erfinderischer Tätigkeit beruhend (nicht offensichtlich) und gewerblich anwendbar anzusehen ist:

- ☐ die gesamte internationale Anmeldung.
☒ Ansprüche Nr. 1-24 in part.

Begründung:

- ☐ Die gesamte internationale Anmeldung, bzw. die obengenannten Ansprüche Nr. beziehen sich auf den nachstehenden Gegenstand, für den keine internationale vorläufige Prüfung durchgeführt werden braucht (*genaue Angaben*):
- ☐ Die Beschreibung, die Ansprüche oder die Zeichnungen (*machen Sie hierzu nachstehend genaue Angaben*) oder die obengenannten Ansprüche Nr. sind so unklar, daß kein sinnvolles Gutachten erstellt werden konnte (*genaue Angaben*):
- ☐ Die Ansprüche bzw. die obengenannten Ansprüche Nr. sind so unzureichend durch die Beschreibung gestützt, daß kein sinnvolles Gutachten erstellt werden konnte.
- ☒ Für die obengenannten Ansprüche Nr. 1-24 in part wurde kein internationaler Recherchenbericht erstellt.
2. Eine sinnvolle internationale vorläufige Prüfung kann nicht durchgeführt werden, weil das Protokoll der Nukleotid- und/oder Aminosäuresequenzen nicht dem in Anlage C der Verwaltungsvorschriften vorgeschriebenen Standard entspricht:
- ☐ Die schriftliche Form wurde nicht eingereicht bzw. entspricht nicht dem Standard.
- ☐ Die computerlesbare Form wurde nicht eingereicht bzw. entspricht nicht dem Standard.

INTERNATIONALER VORLÄUFIGER PRÜFUNGSBERICHT

Internationales Aktenzeichen PCT/EP00/06139

V. B gründete F ststellung nach Artikel 35(2) hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung

1. Feststellung

Neuheit (N)	Ja: Ansprüche	1-24
	Nein: Ansprüche	
Erfinderische Tätigkeit (ET)	Ja: Ansprüche	
	Nein: Ansprüche	1-24
Gewerbliche Anwendbarkeit (GA)	Ja: Ansprüche	1-24
	Nein: Ansprüche	

2. Unterlagen und Erklärungen siehe Beiblatt

Zu Punkt III

Keine Erstellung eines Gutachtens über Neuheit, erfinderische Tätigkeit und gewerbliche Anwendbarkeit

Auf Grund eines Mangels an Klarheit wurde die Recherche beschränkt auf sialisierte Konjugate, wie aus den Beispielen hervorgeht. Die Sachprüfung wird dementsprechend eingeschränkt.

Zu Punkt V

Begründete Feststellung nach Regel 66.2(a)(ii) hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung

Es wird auf die folgenden Dokumente verwiesen:

- D1: REUTER J D u.M.: "Inhibition of Viral Adhesion and Infection by Sialic-acid-Conjugated Dendritic Polymers"**
BIOCONJUGATE CHEMISTRY, Bd. 10, Nr. 2, März 1999 (1999-03), Seiten 271-278, XP000804253 ISSN: 1043-1802
- D2: ZANINI D u.M.: "NOVEL DENDRITIC ALPHA-SIALOSIDES: SYNTHESIS OF GLYCODENDRIMERS BASED ON A 3,3'-IMINOBIS(PROPYLAMINE) CORE"**
JOURNAL OF ORGANIC CHEMISTRY, Bd. 61, Nr. 21, 18. Oktober 1996 (1996-10-18), Seiten 7348-7354, XP002042912 ISSN: 0022-3263
- D3: WU W -Y u.M.: "Synthesis of a polymeric 4-N-linked sialoside which inhibits influenza virus hemagglutinin"**
BIOORGANIC & MEDICINAL CHEMISTRY LETTERS, Bd. 10, Nr. 4, Februar 2000 (2000-02), Seiten 341-343, XP004189928 ISSN: 0960-894X
- D4: Gambaryan A S u.M.: "Specification of Receptor-binding Phenotypes of Influenza Virus Isolates from Different Hosts Using Synthetic Sialylglycopolymers: Non-EGG-adapted Human H1 and H3 Influenza A and Influenza B Viruses Share a Common High Binding Affinity for 6'-sialyl- (N-acetyl)lactosamine)"**
VIROLOGY, Bd. 232, Nr. 2, 9. Juni 1997 (1997-06-09), Seiten 345-350, XP002068479 ISSN: 0042-6822
- D5: Rut r J u.M.: "Sialic acid conjugated dendritic polymers inhibit influenza**

virus binding to target cells in a structural and virus strain-specific manner."

Abstracts of the General Meeting of the American Society for Microbiology, Bd. 98, 1998, Seite 51

&: 98th General Meeting of the American Society for Microbiology; Atlanta, Georgia, USA; May 17-21, 1998, 1998 ISSN: 1060-2011

D6: YAMADA K u.M.: "High performance polymer supports for enzyme-assisted synthesis of glycoconjugates"

CARBOHYDRATE RESEARCH, Bd. 305, Nr. 3-4, 1. Dezember 1997 (1997-12-01), Seiten 443-461, XP004131532 ISSN: 0008-6215

In der vorliegenden Anmeldung werden Konjugate von Sialinsäure mit einem Dendrimer beansprucht. Wenn die Ketten des Dendrimers länger sind werden Aggregate geformt, die die Sialinsäuregruppen verbessert präsentieren. Dieser Grund der Erfindung ist in der vorliegenden Anmeldung von einem einzigen Vergleichsbeispiel unterstützt worden (siehe Tabelle 9, Seite 48).

Die Verwendung von sialierten Polymeren zur Inhibition der viralen Zelladhäsion ist schon bekannt aus u.a. **D1** bis **D5**. Die der Anmeldung zugrundeliegende Erfindung unterscheidet sich von diesem Stand der Technik dadurch, daß die Kettenlänge erhöht worden ist.

Insoweit es 6'SLN betrifft hat der Anmelder klar gezeigt, daß die beanspruchte Konjugate eine stark verbesserte Wirkung aufweisen. Diese verbesserte Wirkung könnte als Argument zur erfinderischen Tätigkeit aufgeführt werden.

Im Vergleichsbeispiel wird aber für Verbindung Nr. 48 eine gesenkte Aktivität im Vergleich mit dem vergleichbaren Konjugat gezeigt. Somit ist klar, daß nicht in allen Fällen die Kettenlänge für die Aggregatbildung, und damit für die verbesserte Aktivität verantwortlich ist, sondern daß auch die Zuckergruppe einen bestimmten Einfluß auf die Wirkung des hergestellten Konjugats aufweist.. Dementsprechend ist es nicht möglich festzustellen, daß der erfindungsgemäße Unterschied tatsächlich für die verbesserte Wirkung verantwortlich ist.

Da die mit der internationalen vorläufigen Prüfung beauftragte Behörde nicht feststellen

kann, daß der Unterschied zwischen Stand der Technik und Erfindung tatsächlich zur beanspruchten Verbesserung führt ist es derzeit nicht möglich, eine erfinderische Tätigkeit für alle beanspruchten Konjugate anzuerkennen.

Zu Punkt VI

Bestimmte angeführte Unterlagen

Bestimmte veröffentlichte Unterlagen (Regel 70.10)

Anmelde Nr. Patent Nr.	Veröffentlichungsdatum (Tag/Monat/Jahr)	Anmeldedatum (Tag/Monat/Jahr)	Prioritätsdatum (zu Recht beansprucht) (Tag/Monat/Jahr)
WO 00 55149	21.9.2000	9.3.2000	12.3.1999

Zu Punkt VIII

Bestimmte Bemerkungen zur internationalen Anmeldung

Die geltenden Patentansprüche sind auf ein Konjugat, ein Verfahren zu dessen Herstellung, oder dessen Verwendung zu beziehen, wobei die charakteristische Gruppe R dieses Konjugats lediglich durch erstrebenswerte Eigenschaften definiert wird. Die Verwendung dieser Parameter muss im gegebenen Zusammenhang als Mangel an Klarheit im Sinne von Art. 6 PCT erscheinen. Es ist unmöglich, die vom Anmelder gewählten Parameter mit dem zu vergleichen, was der Stand der Technik hierzu offenbart.

PCT/EP00/06139

ADDITIONAL MATTER PCT/ISA/210

Continuation of box I.2

Claims Nos.: 1-24

The present patent claims relate to a conjugate, a method for producing the same, and the use thereof, the characteristic group R of said conjugate being each time merely defined by means of desirable properties.

The use of these parameters must be considered in the present context as a lack of clarity under Article 6 PCT. It is impossible to compare the parameters chosen by the Applicant with what is disclosed in the prior art. The present patent application lacks clarity to such an extent that it is impossible to carry out a meaningful search. The search was therefore restricted to sialated conjugates such as are also mentioned in the examples.

The applicant's attention is drawn to the fact that claims, or parts of claims relating to inventions in respect of which no international search report has been established need not be the subject of an international preliminary examination (Rule 66.1(e) PCT). EPO policy, when acting as an International Preliminary Examining Authority, is normally not to carry out a preliminary examination on matter which has not been searched. This is the case, irrespective of whether or not the claims are amended following receipt of the search report (Article 19 PCT) or during any Chapter II procedure whereby the applicant provides new claims.